



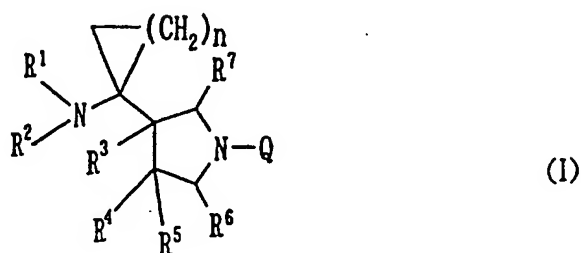
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

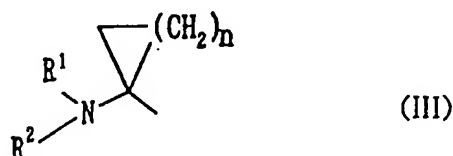
BEST AVAILABLE COPY

<p>(51) 国際特許分類 C07D 401/04, 471/04, 498/06, 207/09, A61K 31/47, 31/535</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO98/52939</p> <p>(43) 国際公開日 1998年11月26日(26.11.98)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/02219</p> <p>(22) 国際出願日 1998年5月20日(20.05.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/131413 1997年5月21日(21.05.97) JP 特願平9/140643 1997年5月29日(29.05.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 竹村 真(TAKEMURA, Makoto)(JP/JP) 高橋 寿(TAKAHASHI, Hisashi)(JP/JP) 杉田和幸(SUGITA, Kazuyuki)(JP/JP) 大木 仁(OHKI, Hitoshi)(JP/JP) 宮内 智(MIYAUCHI, Satoru)(JP/JP) 宮内理江(MIYAUCHI, Rie)(JP/JP) 〒134-0081 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo, (JP)</p>		<p>(74) 代理人 弁理士 萩野 平, 外(HAGINO, Taira et al.) 〒107-6028 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーロパ特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(54) Title: CIS-DISUBSTITUTED AMINOCYCLOALKYL-PYRROLIDINE DERIVATIVES</p> <p>(54) 発明の名称 シス置換-置換アミノシクロアルキルピロリジン誘導体</p> <div style="display: flex; justify-content: space-around; align-items: center;"> <div data-bbox="232 1243 625 1493"> <p>(I)</p> </div> <div data-bbox="919 1297 1230 1457"> <p>(III)</p> </div> </div> <div style="text-align: center; margin-top: 20px;"> <p>(a)</p> </div> <p>(57) Abstract Antibacterial agents which are excellent in antibacterial activity and safety and comprise compounds represented by general formula (I), their salts, or hydrates of the same, wherein R<sup>1</sup> represents hydrogen or alkyl; R<sup>2</sup> represents hydrogen or alkyl; R<sup>3</sup> and R<sup>5</sup> represent each hydrogen; R<sup>4</sup> represents hydroxy, halogeno, carbamoyl, alkyl, alkoxy or alkylthio; R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> represent each hydrogen or alkyl; n is an integer of from 1 to 3; R<sup>8</sup> and the substituent on the pyrrolidine ring of general formula (III) are arranged at the cis-configuration; and Q is a partial structure represented by general formula (a).</p>		

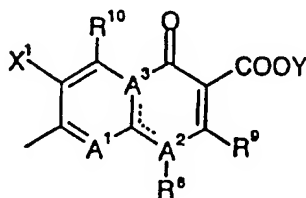
抗菌活性に優れ、かつ安全性にも優れる抗菌薬を提供する。本発明は、下記式(I)で表される化合物、その塩、及びそれらの水和物である。



式中、 $R^1$ ：水素原子、アルキル基、 $R^2$ ：水素原子、アルキル基、 $R^3$ 、 $R^5$ ：水素原子、 $R^4$ ：水酸基、ハロゲン原子、カルバモイル基、アルキル基、アルコキシル基、アルキルチオ基、 $R^6$ 、 $R^7$ ：水素原子、アルキル基、 $n$ ：1から3の整数、 $R^4$ と、ピロリジン環上の置換基である、



とはシス配置である。Qは、下記式で表わされる部分構造を表わす。



PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL アルバニア	FI フィンランド	LR リベリア	SK スロヴァキア
AM アルメニア	FR フランス	LS レソト	SL シエラ・レオネ
AT オーストリア	GA ガボン	LT リトアニア	SN セネガル
AU オーストラリア	GB 英国	LU ルクセンブルグ	SZ スワジランド
AZ アゼルバイジャン	GD グレナダ	LV ラトヴィア	TD チャード
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE グルジア	MC モナコ	TG トーゴ
BB バルバドス	GH ガーナ	MD モルドヴァ	TJ タジキスタン
BE ベルギー	GM ガンビア	MG マダガスカル	TM トルクメニスタン
BF ブルキナ・ファソ	GN ギニア	MK マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR トルコ
BG ブルガリア	GW ギニア・ビサウ	ML マリ	TT トリニダード・トバゴ
BJ ベナン	GR ギリシャ	MN モンゴル	UA ウクライナ
BR ブラジル	HR クロアチア	MR モーリタニア	UG ウガンダ
BY ベラルーシ	HU ハンガリー	MW マラウイ	US 米国
CA カナダ	ID インドネシア	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CF 中央アフリカ	IE アイルランド	NE ニジェール	VN ヴェトナム
CG コンゴ	IL イスラエル	NL オランダ	YU ユーゴスラビア
CH スイス	IS アイスランド	NO ノールウェー	ZW ジンバブエ
CI コートジボアール	IT イタリア	NZ ニュー・ジーランド	
CM カメルーン	JP 日本	PL ポーランド	
CN 中国	KE ケニア	PT ポルトガル	
CU キューバ	KG キルギスタン	RO ルーマニア	
CY キプロス	KP 北朝鮮	RU ロシア	
CZ チェッコ	KR 韓国	SD スーダン	
DE ドイツ	KZ カザフスタン	SE スウェーデン	
DK デンマーク	LC セントルシア	SG シンガポール	
EE エストニア	LI リヒテンシュタイン	SI スロヴェニア	
ES スペイン	LK スリ・ランカ		